

(19)日本国特許庁 (JP)

## (12) 公表特許公報 (A)

(11)特許出願公表番号

特表2001-523714

(P2001-523714A)

(43)公表日 平成13年11月27日 (2001.11.27)

| (51)Int.Cl. <sup>7</sup> | 識別記号                        | F I                        | デマコード(参考)  |
|--------------------------|-----------------------------|----------------------------|--|
| A 6 1 K 31/194           |                             | A 6 1 K 31/194             | 3 B 0 2 9  |
| A 6 1 F 13/00            | 3 5 1                       | A 6 1 F 13/00              | 3 5 1 F 4 C 0 0 3  |
| 13/472                   |                             | A 6 1 K 7/00               | W 4 C 0 8 3  |
| 13/15                    |                             | 7/48                       | 4 C 0 9 8  |
| A 6 1 K 7/00             |                             | 31/14                      | 4 C 2 0 6  |
|                          |                             |                            |  |
|                          |                             | 審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全 36 頁) | 最終頁に統く   |
| (21)出願番号                 | 特願2000-521821(P2000-521821) | (71)出願人                    | ザ、プロクター、エンド、ギャンブル、カンパニー<br>THE PROCTER AND GAMBLE COMPANY<br>アメリカ合衆国オハイオ州、シンシナチ、<br>ワン、プロクター、エンド、ギャンブル、<br>プラザ(番地なし) |
| (86) (22)出願日             | 平成10年11月20日(1998.11.20)     | (72)発明者                    | バルンボ、ジャンフランコ<br>ドイツ連邦共和国、デー - 61348 バート・ホムブルク、ゲオルゲンフェルト<br>7   |
| (85)翻訳文提出日               | 平成12年5月26日(2000.5.26)       | (74)代理人                    | 弁理士 鈴江 武彦 (外5名)  |
| (86)国際出願番号               | PCT/US98/24693              |                            |  |
| (87)国際公開番号               | WO99/26619                  |                            |  |
| (87)国際公開日                | 平成11年6月3日(1999.6.3)         |                            |  |
| (31)優先権主張番号              | 97120699.0                  |                            |  |
| (32)優先日                  | 平成9年11月26日(1997.11.26)      |                            |  |
| (33)優先権主張国               | 欧州特許庁(E P)                  |                            |  |

(54)【発明の名称】 皮膚発疹予防組成物

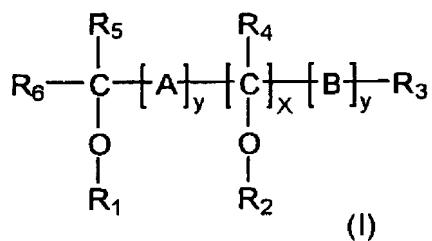
## (57)【要約】

本発明は、組成物の調製に用いられるエステル化合物に係り、それは、脂質分解性皮膚炎に起因した皮膚発疹またはオムツかぶれを、予防または低減または処置するために皮膚に塗布することができ、ローション、クリーム、パウダー、フォーム、オイルなどのようなものに含有させることができる。また、組成物は、オムツ、失禁用パッド、拭き取り用製品などに適用することができる。本発明はまた、皮膚発疹を予防または低減するためのそのような組成物の使用、および外皮上に存在する脂質分解性酵素の酵素活性を低減するためのプロセスに係り、その脂質分解性酵素は、これらの組成物によって、および/またはpHを低下させることによって、外皮上で失活される。

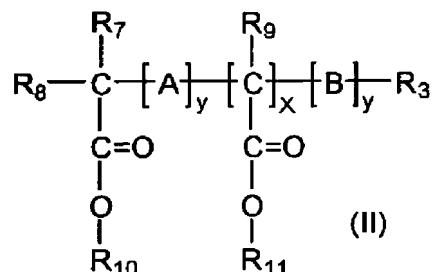
## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 脂質分解性皮膚炎の予防または処置のための組成物の調製のための下記式のエステル化合物の用途。

## 【化1】



または



ここで、R<sub>1</sub>および各R<sub>2</sub>は、独立して、2ないし22の炭素原子を有するアシル基、または1ないし24の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基、または水素、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>の少なくとも1種は、アシル基、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>およびR<sub>9</sub>は、独立して、1ないし24の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシ基、ヒドロキシル基、または水素；R<sub>10</sub>およびR<sub>11</sub>は独立して、2ないし24の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシ基、ヒドロキシ基または水素；AおよびBは独立してC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>の直鎖または分岐したアルキレン、アルケニレン、アルコキシレン、ヒドロキシアルキレン基；xの値は独立して、0ないし15；yの値は独立して0または1である；ただし、x=2およびy

= 0 の場合、少なくとも 1 つの R<sub>2</sub> は 1 ないし 2 4 の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基、または水素である。

**【請求項 2】** オムツかぶれの予防または処置のためである請求項 1 に記載の組成物の調製のためのエステル化合物の用途。

**【請求項 3】** 化合物は、x = 2、y = 0；R<sub>1</sub>、および 1 つの R<sub>2</sub> が C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub> アシル基、R<sub>10</sub> および 1 つの R<sub>11</sub> は C<sub>1</sub>～C<sub>16</sub> のアルキル基；R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub> および R<sub>9</sub> は水素である式 I または II のものである請求項 1 または 2 に記載の組成物の調製のためのエステル化合物の用途。

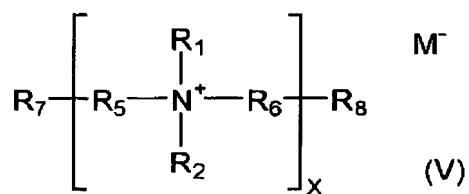
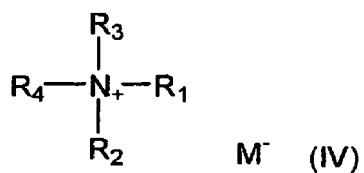
**【請求項 4】** 化合物は、クエン酸またはその塩のモノエステルまたはジエステル、クエン酸のトリエステル、または酒石酸またはその塩のモノエステル、または酒石酸のジエステルである請求項 1 ないし 3 のいずれか 1 項に記載の組成物の調製のための化合物の用途。

**【請求項 5】** 化合物は、グリセロールモノーまたはジーアセテートである請求項 1 ないし 3 のいずれか 1 項に記載の組成物の調製のための化合物の用途。

**【請求項 6】** エステル化合物は、重量で 0.01% ないし 90% のレベルで存在する請求項 1 ないし 5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

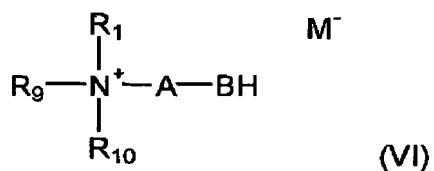
**【請求項 7】** 下記式のカチオン性化合物

**【化 2】**



または酸性源およびその等電点において下記式を有する両性化合物が付加的に使用される、請求項1ないし5のいずれか1項に記載の組成物の調製のための化合物の用途。

【化3】



ここで、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ および $R_4$ は、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>22</sub>の直鎖または分岐したアルキル基、アルケニル基、アリール基、アリールアルキル基、アミドアルキル基、(ポリ)アルコキシ基、ヒドロキシアルキル基、またはアシル基からなる群から選択され、あるいは $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ および $R_4$ の2つ以上の基は、互いに環構造を形成し； $R_5$ 、 $R_6$ およびAは独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>22</sub>の直鎖または分岐したアルキレン基、アルケニレン基、(ポリ)アルコキシレン基、ヒドロキシアルキレン基、アリールアルキレン基またはアミドアルキレン基からなる群から選択

され；R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、独立してC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>のアルキル基、アルケニル基、アルコキシ基またはヒドロキシ基または水素；R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>22</sub>の直鎖または分岐したアルキル基、アルケニル基、アリール基、アリールアルキル基、アミドアルキル基、（ポリ）アルコキシ基、ヒドロキシアルキル基、またはアシル基からなる群から選択され、あるいはR<sub>1</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>の2つ以上の基は互いに環構造を形成し；BHはプロトン供与基であり；xは1から4であり；M<sup>-</sup>は対イオンである。

**【請求項8】** 組成物は請求項7のカチオン性化合物を含有する請求項1ないし5および7のいずれか1項に記載の組成物の調製のためのエステル化合物の用途。

**【請求項9】** カチオン性化合物は、1種以上の置換されたR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>9</sub>またはR<sub>10</sub>基および／または置換されたR<sub>5</sub>および／または置換されたR<sub>6</sub>基を含有し、置換基は、シリコン、グルコース、フラクトースおよびサッカロースの誘導体からなる群から選択される請求項7または8に記載の用途。

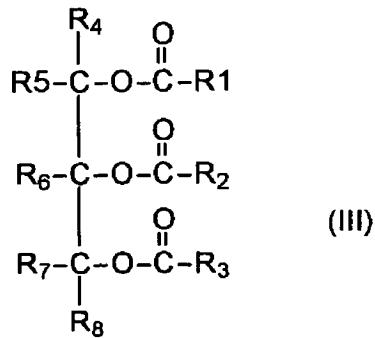
**【請求項10】** カチオン性化合物は、C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>の、好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>のアルキル基、アルケニル基または（ポリ）アルコキシ基、最も好ましくはメチル基またはエチル基であるR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>9</sub>の少なくとも1種を含む請求項7または8に記載の用途。

**【請求項11】** カチオン性化合物は、式(VI)のものであり、ベタイン化合物またはスルホベタイン化合物である請求項7または8に記載の用途。

**【請求項12】** 請求項6ないし10のいずれか1項のカチオン性化合物が、組成物の重量の0.01%ないし20%のレベルで存在する請求項6に記載の組成物。

**【請求項13】** 下記式の付加的なエステル化合物が用いられる請求項1ないし5および7ないし11のいずれか1項に記載の組成物の調製のためのエステル化合物の用途。

**【化4】**



ここで、 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ および $\text{R}_3$ は、独立して、1ないし22の炭素原子を有するアルキル基またはアルケニル基またはヒドロキシアルキル基であり、 $\text{R}_4$ 、 $\text{R}_5$ 、 $\text{R}_6$ 、 $\text{R}_7$ および $\text{R}_8$ は、独立して、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ の直鎖または分岐したアルキル基、アルケニル基またはヒドロキシアルキル基、ヒドロキシ、塩化物、臭化物、アミンまたは水素からなる群から選択される。

**【請求項14】** 請求項13に記載の付加的なエステル化合物はグリセロールトリアセテートである請求項1ないし5および7ないし13のいずれか1項に記載の組成物の調製のためのエステル化合物の用途。

**【請求項15】** 請求項1ないし14のいずれか1項に記載の請求項1ないし5のいずれか1項に記載のエステル化合物を含有する使い捨て吸収性製品であって、エステル化合物は製品の重量の0.01%ないし10%のレベルで存在する吸収性製品。

**【請求項16】** オムツの形状の請求項15に記載の使い捨て吸収性製品において、前記オムツはトップシートを含み、請求項1ないし14のいずれか1項に記載の化合物を含有する使い捨て吸収製品。

**【請求項17】** 請求項16に記載に使い捨て吸収性製品の製造方法において、トップシートは、オムツへのトップシートの取り込み前に、請求項1ないし14のいずれか1項の組成物で含浸される使い捨て吸収性製品の製造方法。

**【請求項18】** 外皮または使い捨て吸収性製品への局所的な適用のためのフォームクリーム、ローション、ゲル、オイル、軟膏またはパウダーの状態の請

請求項1ないし14のいずれか1項に記載の化粧品組成物であって、実質的に炭酸塩を含有しない化粧品組成物。

**【請求項19】** 請求項1ないし5のいずれか1項に記載の組成物を（局所的に）適用する工程を具備する、外皮上に存在する酵素の酵素活性を低減する方法。

**【請求項20】** 請求項1ないし14のいずれかに記載の組成物または組成物を含む吸収性製品を、外皮に（局所的に）適用する工程を具備する外皮上に存在する酵素の酵素活性を低減する方法。

**【発明の詳細な説明】****【0001】****【発明の属する技術分野】**

本発明は、組成物の調製のために用いられるエステル化合物に係り、その組成物は、脂質分解性の皮膚炎に起因した皮膚発疹またはオムツかぶれを予防または低減または処置するために皮膚に適用することができ、ローション、クリーム、パウダー、フォーム、オイル等に取り込まれることができる。組成物はまた、オムツ、失禁用パッド、拭き取り製品などのようなものに適用することも可能である。

**【0002】**

また本発明は、皮膚発疹を予防または低減するためのそのような組成物の使用、および外皮に存在し、そのような組成物によっておよび／またはpHの低下によって不活性化される脂質分解性酵素の酵素活性を低減するためのプロセスを提供する。

**【0003】****【従来の技術】**

皮膚炎により引き起こされる皮膚発疹は、しばしばオムツかぶれとよばれ、オムツ、失禁用製品、生理用ナプキン、小児用トレーニングパンツのような使い捨て吸収性製品の使用者が直面する問題とされてきた。それゆえ、こうした使用者にとっての大きな要求の一つは、このタイプの皮膚発疹の問題を解決することにある。

**【0004】**

皮膚発疹の発生に影響を及ぼす主な要因は、直接のまたは例えば吸収性製品中に含まれる、湿った身体放出物との皮膚の接触である。特に、水分含有量が高い場合、皮膚発疹は容易に引き起こされる。

**【0005】**

オムツおよびスキンケア製品の製造業者は、オムツかぶれ（または皮膚発疹）の発生を低減することを助ける種々の製品を、過去10年間にわたって開発してきた。

**【0006】**

それによって主な関心の的は、身体放出物へ皮膚が曝されるのを低減することにあった。これは、例えば吸収性またはより優れた吸収性の材料をオムツへ取り込むことによって行なわれる。したがって、皮膚に接触する水分の量は低減される。

**【0007】**

皮膚発疹の問題に取り組むために開発された他の製品は、身体放出物のある成分へ皮膚が曝されることを低減する。放出物のそのような成分の例は、皮膚を汚染して皮膚発疹を発生または悪化させるおそれのあるバクテリアである。

**【0008】**

例えば、皮膚と身体放出物との間にバリアを形成できるローションが開発されてきた。また、抗炎症性の組成物を、皮膚または吸収性製品に適用することもできる。

**【0009】**

E P O 1 9 1 1 2 8には、皮膚への刺激を処置するための8-ヒドロキシキノリン硫酸塩を含有する調合剤が開示されている。

**【0010】**

しかしながら、オムツまたは皮膚かぶれを予防するために適用し得る市販の多くの製品にもかかわらず、オムツのような吸収性製品の使用者のなかの最も深刻な症状の人は、依然として皮膚またはオムツかぶれが残る。

**【0011】**

さらにもう一つの要因が、皮膚の発疹を引き起こす、あるいは悪化させるおそれがあることがわかつてきた。すなわち、身体放出物中の種々の酵素、特にリパーゼ酵素の存在である。

**【0012】**

E P O 1 1 7 6 3 2 Bは、リパーゼ抑制剤、好ましくは亜鉛含有成分と、ベヒクル物質とを含有する使い捨て製品に関する。

**【0013】**

U S 3, 9 6 1, 4 8 6は、リパーゼ酵素の活性を低下させるため、および皮

膚発疹を低減するためのアジピン酸の使用を開示している。

#### 【0014】

皮膚がリパーゼ酵素に曝された場合には、例えば身体放出物中のリパーゼ酵素によって、皮膚の脂質含有成分はこれらの酵素によって影響されるおそれがある。皮膚（角質層、Stratum Corneum）の最上層の保護またはバリア作用は、こうして低減されるであろう。これは、皮膚の健康を害し、および／または皮膚の汚染を促進し得る。これは、皮膚またはオムツかぶれを引き起こすおそれがある。

#### 【0015】

特定のエステル化合物は、リパーゼ酵素基質として作用することができる事が見出されてきた。特定のエステル化合物は、加水分解性リパーゼ酵素、これはエステラーゼ酵素であるが、により作用されると、加水分解され遊離酸の放出をもたらすであろう。本発明者らは、こうした酸の存在は、まず、エステルが局所的に適用される領域のpHを低下させることを見出した。これは、この領域内、身体放出物中に存在する全てまたはほとんどの酵素、リパーゼ酵素、プロテアーゼ酵素のようなものの不活性化に等しい。次いで、リパーゼ酵素は“失活”される。なぜなら、脂質のような皮膚のエステルを加水分解するよりも、むしろ別の基質、すなわち本発明のエステル化合物を、それらは加水分解するからである。

#### 【0016】

本発明者らは、これらのエステル化合物の使用は、特に脂質分解性のエステラーゼ酵素により引き起こされる皮膚炎に起因した、オムツ／皮膚かぶれを非常に効果的に低減すること、またはその予防または治療を助けることを見出した。外皮上における脂質分解酵素の酵素活性を低減するためのプロセスは、こうして与えられ、本明細書に含まれる。

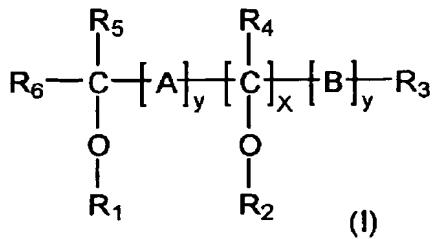
#### 【0017】

##### 【課題を解決するための手段】

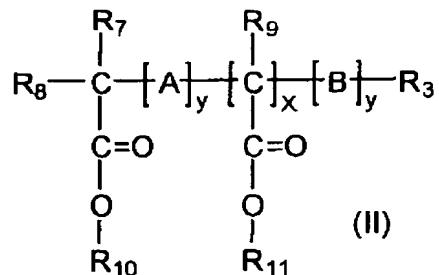
本発明は、脂質分解性皮膚炎の予防または処理のための組成物の調製のための、下記化学式の1つ以上のエステル化合物の使用に関する。

#### 【0018】

## 【化5】



または



## 【0019】

ここで、 $R_1$  および各  $R_2$  は、独立して 2 ないし 22 の炭素原子を有するアシル基、または 1 ないし 24 の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基、または水素、ここで  $R_1$  および  $R_2$  の少なくとも 1 種はアシル基、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、および  $R_9$  は独立して、1 ないし 24 の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシ基、ヒドロキシ基、または水素； $R_{10}$  および  $R_{11}$  は、独立して 2 ないし 24 の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基、アルコキシ基、ヒドロキシ基、または水素； $A$  および  $B$  は独立して、 $C_1 \sim C_6$  の直鎖または分岐したアルキレン基、アルケニレン基、アルコキシレン基、ヒドロキシアルキレン基； $x$  の値は独立して 0 ないし 15 であり； $y$  の値は独立して 0 または 1 である；ただし  $x = 2$ 、 $y = 0$  の場合には、少なくとも 1 つの  $R_2$  は、1 ないし 24 の炭素原子を有するアルキル基、アルケニル基、アリールアルキル基、ヒドロキシアルキル基または水素である。

**【0020】**

本発明はまた、好ましくは、製品の重量の0.01%ないし10%のレベルでその中にエステル化合物が存在するような、上述したような組成物を有する使い捨て吸収性製品、好ましくはオムツを提供しする。ここで、組成物はオムツのトップシートに含まれることが好ましい。

**【0021】**

また本発明は組成物を提供し、それは、化粧品組成物の状態、クリーム、ローション、ゲル、フォーム、オイル、軟膏またはパウダーの状態であり、好ましくは、外皮への局所的な適用のために、炭酸カルシウムを実質的に含まない。

**【0022】****【発明の実施の形態】**

エステル化合物は、本発明において（外）皮膚の脂質分解性皮膚炎の予防、低減または処置のための組成物の調製に用いられる。

**【0023】**

これらのエステルは、酵素基質として作用し、それは、加水分解性脂質分解エステラーゼ酵素により作用されると、加水分解して遊離酸の放出を引き起こすであろう。これらの酸の存在は、エステルが局所的に適用される領域のpHを低下させることができる。これは、この領域内、身体放出物中に存在する脂質分解性エステラーゼ酵素の失活または不活性化に等しいであろう。失活または不活性化されなければ、エステラーゼ酵素は皮膚に影響を及ぼして、炎症または皮膚発疹をもたらすおそれがある。

**【0024】**

処置または低減によって、本明細書において、皮膚上に存在する脂質分解性酵素によって引き起こされる皮膚炎または皮膚の発疹の低減、あるいは、これらの酵素によって引き起こされる皮膚炎または皮膚の発疹を少なくとも一定に保つことが意味される。

**【0025】**

本発明のエステル化合物の使用により調製される組成物は、少なくとも脂質分解性酵素に接触する皮膚に塗布することができる。また、そのような組成物は、

クリーム、ローション、オイル、軟膏、フォーム、パウダーまたはゲル中に含まれることができ、これらは皮膚に局所的に塗布することができる。

#### 【0026】

あるいは、本発明の組成物は、これらの脂質分解性酵素に接触する皮膚に密着して接触される吸収性製品に適用することができる。そのような製品は、好ましくは、オムツ、失禁用パッド、小児用トレーニングパンツ、生理用ナプキン、女性用衛生用品、湿ったまたは乾燥した拭き取り製品（w i p e）などの使い捨て製品である。

#### 【0027】

“局所的な適用”または“局所的（に）適用する”という用語は、本明細書において用いられる際、表皮組織、特に外皮に直接置かれるまたは塗られることが意味される。

#### 【0028】

本発明のエステル化合物を含有する組成物の量は、処置される状態の特定の位置、処置される状態のひどさ、処置の期待される継続期間、組成物自体またはエステル化合物の濃度のいずれかに対する使用者に特有の特効性の感受性、使用者の状態、施される同時治療、使用者に起こっている他の症状に応じて変化させることができる。

#### 【0029】

本発明のために、脂質分解性皮膚炎の処置を必要としている領域、または脂質分解性皮膚炎の予防が望まれる領域に、存在するリバーゼの活性を抑制するため有効な状態で、リバーゼ酵素失活剤または抑制剤として作用するために、本発明のエステル化合物を含有する組成物の最小抑制濃度が、局所的に適用されることが好ましい。

#### 【0030】

この領域（またはここで用いられるような“変調をきたした領域”）は、任意のレベルの皮膚の発疹または脂質分解性皮膚炎が現在存在している皮膚の領域、または酵素を含む身体放出物と長期間接触するおそれがある領域を意味する。また、これは、述べられた領域にすぐ近くの領域も含む。それは、処置、低減、お

および／または予防が望まれる領域である。

### 【0031】

#### 脂質分解性皮膚炎

本発明は、上述したようなエステル化合物の使用により調製された組成物、または本発明の組成物を含有する（使い捨て）吸収性製品にかかり、それは、皮膚または特に、身体放出物中に存在する脂質分解性のエステラーゼ酵素により引き起こされるオムツかぶれまたは皮膚炎（脂質分解性皮膚炎）、および、身体放出物との皮膚の長時間の接触および／または吸収性製品、特にオムツをつけることに関連した他の症状の処置のために用いることができる。

### 【0032】

脂質分解性エステラーゼ酵素は、エステルまたはエステル結合を含む化合物、脂質のようなものを加水分解することができ、それによって酸またはその塩およびアルコールを生成する酵素である。

### 【0033】

リパーゼ、リパーゼ酵素または脂質分解性酵素は、エステラーゼに属する酵素の群を表わすために用いられる平凡なまたは通常の用語である。それらの一般的な活性は、エステル状態で存在する脂肪（ヒトの皮膚にみられるグリセライドのようなもの）を加水分解することであり、したがって、脂肪酸とグリセロールとを生成する。この群の酵素は、植物、かび、バクテリア、牛乳および乳製品の中に、ほとんど全ての動物組織中と同様に非常に広く分布されているため、そのうえヒトリパーゼ酵素はすい臓浸出物中に存在するので、それらは身体放出物中にほとんど常に存在する。

### 【0034】

酵素、特にリパーゼ酵素の活性は、ほとんど全ての皮膚発疹、特にオムツかぶれの一因となり、皮膚の上におけるこれらの酵素自体の消化分解作用によって、および（脂質）皮膚成分を分解することによって炎症を引き起こし、変調をきたした領域内の皮膚のバリア特性を弱める。皮膚の完全な状態がこのように衰えることは、身体放出物（特に尿および糞便）の他の成分（これらは、それ自体では炎症性ではないかもしれない）が、弱められた皮膚中を移動するのを許す。この

時点において、通常は無害な成分が、その後に炎症性となるかもしれない。

### 【0035】

#### 組成物

##### エステル化合物

本発明は、皮膚の発疹、特にオムツかぶれの処置、予防または低減のために用いることができる組成物の調製における使用のための上述したような特定のエステル化合物を提供する。そのような皮膚の発疹は、脂質分解性酵素により発生または悪化され、こうして、脂質分解性皮膚炎の結果となる。

### 【0036】

本発明の目的のために、上述した式(I)および(II)における基R<sub>1</sub>～R<sub>11</sub>は、分岐または直鎖とすることができます、それらは任意の適切な置換基で置換されてもよいことが理解されるべきである。

### 【0037】

エステル化合物は、上述した式(I)または(II)のモノー、またはジエステルであって、1または2つの酸性基を有することが好ましい。

### 【0038】

エステル化合物における酸性基の存在は酸性源を与え、それは、変調をきたした領域のpHを低めることができ、それによって、皮膚上の身体放出物中に存在する酵素の活動抑制または不活性化を助ける。

### 【0039】

上で定義したような式(I)および(II)のエステル化合物は、xが1、より好ましくは2であり、yが0である式IまたはIIの化合物が好ましい。

### 【0040】

好ましいエステル化合物は、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>のアシル基であるR<sub>1</sub>および一つのR<sub>2</sub>を有する。

### 【0041】

また、R<sub>10</sub>またはR<sub>11</sub>は、好ましいとすることができるが、最も好ましくはR<sub>10</sub>および1つ以上のR<sub>11</sub>はC<sub>1</sub>～C<sub>16</sub>のアルキル基である。

### 【0042】

非常に好ましいのは、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>の1種以上、または好ましくは、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>の全てがメチル、より好ましくは水素である。

#### 【0043】

エステル化合物は、グリセロールモノーまたはジーアセテート、またはクエン酸のモノーまたはジエステルまたはトリエステル、または酒石酸のモノーまたはジエステルであることがより好ましく、トリエチルクエン酸塩、ジイソプロピル酒石酸塩、ジエチル酒石酸塩、ジブチルL-酒石酸塩のようなものである。

#### 【0044】

組成物は、好ましくは組成物の重量の0.01%ないし90%の、より好ましくは0.5%ないし60%の、最も好ましくは2%ないし25%のレベルのエステル化合物を含有する。

#### 【0045】

組成物は、従来知られている任意の通常の処方技術により調製することができる。

#### 【0046】

ローション、クリーム、オイル、フォーム、軟膏、ジェル、パウダーなど

本発明のエステル化合物の使用により調製される組成物は、また、化粧品組成物の状態、ローション、クリーム、オイル、軟膏、パウダー、フォーム、ゲルの状態とすることができます、それはそのような組成物のために従来通常用いられる任意の成分を含むことができる。

#### 【0047】

本発明の化粧品組成物が皮膚への塗布のためである場合には、それらは、残置(leave-on)製品として皮膚に塗布できるような状態であることが好ましい。

#### 【0048】

化粧品クリーム、ローション、ゲル、オイル、軟膏またはパウダーは、好ましくは、炭酸カルシウムのような炭酸塩を実質的に含まない。

#### 【0049】

上述した組成物の成分は、組成物の特性に依存することが理解されるべきであり、したがってローションは、一般にパウダー以外の別の付加的な成分を含有することができる。

#### 【0050】

本発明の組成物を含有する化粧品クリーム、ローション、ゲル、オイルまたはパウダー中には、好ましくは酸性源が存在し、8未満のpH、より好ましくは7未満のpH、より好ましくは6未満のpH、さらにより好ましくは5未満のpHまで皮膚のpHを低減できるようなものが好ましい。

#### 【0051】

非閉塞性のモイスチャライザー、潤滑剤、ゲル化剤、中和剤、香料、着色剤のような広い範囲の種々の任意成分は、本発明における皮膚組成物に加えることができる。

#### 【0052】

他の付加的な成分は、アニオン性、ノニオン性、カチオン性、両性イオン性および両親媒性界面活性剤とすることができます、それらは従来知られている。

#### 【0053】

##### 吸收性製品

本発明の組成物は、吸收性製品、好ましくは使い捨て吸收性製品に含ませることができる。そのために特に好ましい吸收性製品はオムツであり、それは、好ましくはオムツのトップシートに組成物を含む。

#### 【0054】

本明細書において用いられる際、“吸收性製品”という用語は、身体放出物を吸収して収容するデバイスをさし、より具体的には、装着者の身体に押し付けてまたは近接して配置され、身体から放出される種々の放出物を吸収して収容するデバイスをさす。“使い捨て”という用語は、ここで用いられる際、洗濯されること、または吸收性製品として再保管または再使用されることが意図されない吸收性製品を表わす（すなわち、それらは、一回の使用後に捨てられることが意図され、好ましくは、リサイクルされ、コンポストされ、または環境的に適合した手法で廃棄される）。

**【0055】**

使い捨て吸収性製品の構造は、本発明の実施に重要ではない。

**【0056】**

通常、組成物は、好ましくは頻発した使用の後に、脂質分解性皮膚炎の要求される処置または低減または予防を達成できるような量で、吸収性製品またはオムツ中に取り込まれることが特に好ましい。

**【0057】**

使い捨て吸収性製品は、好ましくは製品の重量の0.01%ないし30%、より好ましくは0.01%ないし10%、最も好ましくは0.05%ないし5%のレベルでエステル化合物がその中に存在するような本発明の組成物を含有することが好ましい。

**【0058】**

吸収性製品は、一般に、

- ・吸収性コア（副構造体からなることができる）；
- ・流体透過性トップシート；
- ・流体不浸透性バックシート；
- ・任意に、閉鎖要素または伸縮体のようなさらなる部材（feature）を含む。

**【0059】**

ここで用いられる際、“オムツ”という用語は、装着者の胴体の下部の周りに装着され、幼児または失禁の患者により一般に装着される吸収性製品をさす。しかしながら、本発明は、また、失禁用ブリーフ、失禁用下着、オムツホルダーおよびライナー、女性用衛生用品などにも適用可能であることが理解されるべきである。

**【0060】**

本発明の目的のための好ましい拭き取り製品は、吸収性の纖維質材料またはコアを含み、その中に、組成物を放出可能に取り込むことができる。本発明の目的のための非常に好ましい使い捨て拭き取り製品は、吸収性の纖維質材料と糞便不浸透性のバッキング材とを含み；前記バッキング材は前記吸収性の纖維質材料の

一つの面に重ねられる、あるいはその繊維質材料と同一の広がりを有し；前記バッキング材は、最も好ましくはウェブーバッキング材であり、最も好ましくは前記吸収性材料よりも大きな幅を有して、前記吸収性材料を越えて広がるサイドマージン部分を与える。前記マージン部分は、前記吸収性材料の端の周りおよび上に折り畳まれる。本発明の組成物の薬剤は、拭き取り製品構造体中に、当業者に容易にわかる種々の方法によって、放出可能に取り込まれることができる。例えば、組成物は、水、エタノールなどのような水性または揮発性のキャリア中に、あるいは、クリーム、ローション、オイル、軟膏、ゲルまたはパウダー中に存在させることができ、スプレー、ディッピング、プリント、浸漬によって、あるいは拭き取り製品の吸収性材料を、リバーゼ抑制剤およびそのキャリアに接触させることによって吸収性材料に適用することができる。皮膚清浄剤、好ましくは油性の清浄剤もまた、吸収性材料の中に同様にして放出可能に任意に取り込むことができる。

#### 【0061】

本発明の組成物は、好ましくは、オムツ、好ましくは吸収性のコア構造体、最も好ましくはトップシート構造体に取り込むことができる。組成物は、当業者に容易に分かる種々の方法によってオムツ構造体に取り込むことができる。例えば、組成物は、水、エタノールなどのような水性または揮発性のキャリアに任意に分散させた後、スプレー、ディッピング、印刷、浸漬によって、あるいはオムツの選択された構造体要素を組成物に、および任意にそのキャリアに接触させることによって（これは、本明細書において含浸（imregnation）と呼ばれる）、オムツトップシートに、吸収性コアに、またはバックシートのコア側に適用することができる。

#### 【0062】

オムツは、好ましくは、液体透過性のトップシート、トップシートに接続された液体不透過性バックシート、トップシートとバックシートとの間に位置する吸収性コアを含む。トップシート、バックシート、および吸収性コアは、種々のよく知られている形状に組み合わせができるが、好ましいオムツ形状は、1975年1月14日にKenneth B. Buelに発行された“Cont

tractable Side Portions for Disposab le Diaper”というタイトルの米国特許第3, 860, 003号；および1991年6月13日に出願されたKenneth B. Buelの米国特許出願シリアルNo. 07/715, 152 “Absorbent Article With Dynamic Elastic Waist Feature Having A Predisposed Resilient Flexural Hinge”に一般に記載されている。

#### 【0063】

バックシートは、吸収性コアの衣類側面に隣接して位置し、好ましくは、従来当業者によく知られている取り付け手段によってそこに接続される。例えば、バックシートは、接着剤の均一な連続層、接着剤のパターン化された層、または接着剤の別個の線、螺旋または点の配列によって吸収性コアにしっかりと取り付けることができる。満足であることが見出された接着剤は、セントポール、ミネソタのエイチビーフラー社 (H. B. Fuller Company) により製造されHL-1258として市販されている。取り付け手段は、好ましくは1986年3月4日にMinetola et al. に発行された“Disposable Waste-Containment Garment”というタイトルの米国特許第4, 573, 986号に記載されているような接着剤のフィラメントのまばらなパターンネットワーク、より好ましくは、螺旋パターンに巻かれた接着剤フィラメントのいくつかのラインを含み、それは、1975年10月7日にSprague, Jr. に発行された米国特許第3, 911, 173号；1978年11月22日にZiecker, et al. に発行された米国特許第4, 785, 996号；および1989年6月27日にWerencicに発行された米国特許第4, 842, 666号に示されている装置および方法により説明されるようなものである。あるいは、取り付け手段は、熱的結合、圧力結合、超音波結合、ダイナミックメカニカル結合 (dynamic mechanical bonds)、または任意の他の適切な取り付け手段、または従来知られているようなこれらの取り付け手段の組み合わせを含むことができる。

#### 【0064】

吸収性製品は、従来よく知られているような伸縮部材または閉鎖手段を含むことができ、例えばE 0 2 5 4 4 7 6 (A l e m a n y) に記載されているようなものである。

#### 【0065】

トップシートは、吸収性コアの体側面に隣接して位置し、好ましくは、それに対しておよびバックシートに、当業者に従来よく知られているような取り付け手段によって接続される。本明細書において用いられる際、“接続される”という用語は、構成要素を他の構成要素に直接貼ることによって、構成要素が他の構成要素にしっかりと直接取り付けられた形状；および他の構成要素に貼られた介在する構成要素に構成要素を貼ることによって、構成要素が他の構成要素に間接的に取り付けられた形状を包含する。

#### 【0066】

一般に、トップシートは、柔軟でソフトな感触で、装着者の皮膚に対して刺激がない。さらに、トップシートは、その厚さを通して液体（例えば、尿）が容易に浸透するのを可能にする液体透過性である。適切なトップシートは、広い範囲の材料から作製することができ、多孔質発泡体；網状発泡体；孔あきプラスチックフィルム；または天然纖維（例えば、木質または綿纖維）、合成纖維（例えば、ポリエステルまたはポリプロピレン纖維）、または天然および合成纖維の組み合わせの織布または不織布材料のようなものである。トップシートを製造するために用い得る多くの製造技術が存在する。例えば、トップシートは、スピン結合された、カードされた、湿式敷設された（w e t - l a i d）、溶融ブローされた（m e l t b l o w n）、水中からみ合いさせた（h y d r o e n t a n g l e d）、上述の組み合せなどの纖維の不織布ウェブとすることができます。

#### 【0067】

好ましくは、トップシートは材料の親水性を調節するための成分（m e a n s）を含む。

#### 【0068】

吸収性コアは、吸収性製品のトップシート以外の実質的に全ての吸収性部分を含み、それらは流体吸収性または流体取扱いに寄与する。

**【0069】**

吸収性コアは、一般に圧縮可能で、従順で、装着者の皮膚に対して刺激がなく、尿や他の身体放出物のような液体を吸収して保持できるべきである。

**【0070】**

吸収性コアは、種々の材料で作製することができる。好ましい材料は、纖維質材料であり、纖維質ウェブ、天然にあるまたは合成の纖維、または任意に熱可塑性纖維とすることができる。それらに加えて、ポリマー性硬化剤は好ましく存在する。また、ヒドロゲル形成ポリマーまたは吸収性ポリマーも、好ましいとすることができる。

**【0071】**

種々のコア、トップシートおよびバックシートの材料は、Weismann et al. (EP 0202125) またはAlemanny et al. (EP 0254476) に記載されているような、従来知られている任意の方法で配置することができる。

**【0072】**

本発明の組成物を含むオムツを製造するためのプロセスもまた、本発明に含まれ、それにおいては、トップシートは、オムツに取り込まれる前に組成物で含浸される。

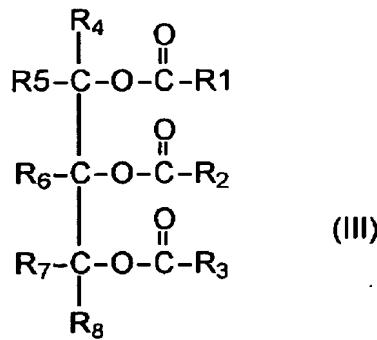
**【0073】****付加的成分**

本発明の組成物は、付加的な成分を含むことができる。存在する成分およびレベルは、組成物の特性およびその用途に依存する。

**【0074】**

本発明の組成物の調製における使用のため、または組成物における使用のために非常に好ましいもう一つのエステル化合物は、下記式のエステル化合物とすることができる。

**【0075】****【化6】**



## 【0076】

ここで、 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ および $\text{R}_3$ は、独立して、1ないし22の炭素原子を有するアルキル基またはアルケニル基またはヒドロキシアルキル基であり、 $\text{R}_4$ 、 $\text{R}_5$ 、 $\text{R}_6$ 、 $\text{R}_7$ および $\text{R}_8$ は、独立して、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ の直鎖または分岐したアルキル基、アルケニル基またはヒドロキシアルキル基、ヒドロキシ、塩化物、臭化物、アミンまたは水素からなる群から選択される。

## 【0077】

非常に好ましいのは、前記化合物の $\text{R}_4$ 、 $\text{R}_5$ 、 $\text{R}_6$ 、 $\text{R}_7$ および $\text{R}_8$ が水素であり、好ましくは $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ および $\text{R}_3$ が、独立して $\text{C}1 \sim \text{C}4$ のアルキル基である化合物である。

## 【0078】

そのような好ましい化合物は、グリセロールトリアセテートとすることができる。

## 【0079】

本発明の組成物の調製のために、または本発明の組成物における使用のために用いられるもう一つの非常に好ましい付加的な成分は、ある種のカチオン性成分であることが見出された。

## 【0080】

リパーゼは、すい臓の胆汁塩の存在により活性化されることが見出されており、それは身体放出物中にたいてい存在する。胆汁塩は乳化剤として作用し、水-脂質界面においてリパーゼ酵素が作用するのを可能にする。

**【0081】**

本発明の組成物中にカチオン性化合物を用いる場合には、胆汁塩が不活性化され、したがってリパーゼが不活性化される。それによって皮膚に作用して、炎症を引き起こすことが妨げられる。リパーゼのそのような不活性化は、皮膚のバリア機能の低下を防止し、それは刺激物（菌、バクテリア、および胆汁塩および酸のようなもの）がとおって移動することを、さらには皮膚を刺激して炎症を起こすことを防止する。

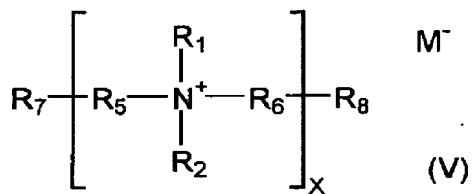
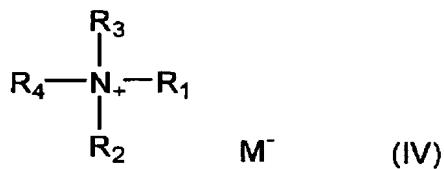
**【0082】**

本発明の組成物において、そのようなカチオン性成分の使用は、驚くべき効果を有することがわかった：カチオン性成分は即時効果、すなわち、リパーゼ酵素の即時の抑制または不活性化を与えることが見出され、それは、時間にわたって減少するかもしれない。一方、エステル化合物の効果は比較的遅れるが、長続きする。したがって、二つの化合物の組み合せは、皮膚上で身体放出物中に存在する酵素により引き起こされる皮膚炎に起因するオムツ／皮膚かぶれの非常に効果的で、即時のかつ長続きする低減または防止を与える。

**【0083】**

本発明の組成物における使用のためのカチオン性成分は、好ましくは下記式のものである。

**【0084】****【化7】**

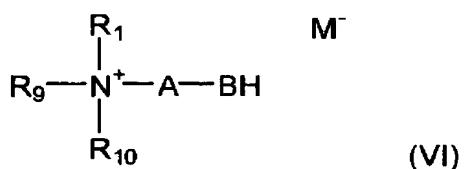


## 【0085】

あるいは、両性化合物および好ましくは酸性源であり、両性化合物は、その等電点において下記式を有する。

## 【0086】

## 【化8】



## 【0087】

ここで、 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ 、 $\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ は、独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_{22}$ のアルキル基、アルケニル基、アリール基、アリールアルキル基、アミドアルキル基、(ポリ)アルコキシ基、ヒドロキシアルキル基、またはアシル基、または $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_2$ 、 $\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ の2つ以上の基は、互いに結合して1つ以上の環構造を形成してもよく； $\text{R}_5$ 、 $\text{R}_6$ および $\text{A}$ は、独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_{22}$ のアルキレン基、アルケニレン基、(

ポリ) アルコキシレン基、ヒドロキシアルキレン基、アリールアルキレン基またはアミドアルキレン基；R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は、独立してC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>のアルキル基、アルケニル基、アルコキシ基またはヒドロキシ基または水素；R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>は、独立してC<sub>1</sub>～C<sub>22</sub>の直鎖または分岐したアルキル基、アルケニル基、アリール基、アリールアルキル基、アミドアルキル基、(ポリ)アルコキシ基、ヒドロキシアルキル基、またはアシル基、あるいはR<sub>1</sub>、R<sub>9</sub>およびR<sub>10</sub>の2つ以上の基は、互いに1つ以上の環構造を形成し；BHはプロトン供与基であり；xは2ないし4であり；およびM<sup>-</sup>はカウンターイオンである。

#### 【0088】

本発明の目的のために、上述した式(IV)、(V)および(VI)のR<sub>1</sub>～R<sub>10</sub>は、任意の適切な置換基で置換されてもよいことが理解されるべきである。

#### 【0089】

上述した式(IV)、(V)および(VI)において、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>9</sub>は、独立して、好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>の、より好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>のアルケニル基またはアルコキシ基、より好ましくはアルキル基、最も好ましくはメチル基またはエチル基である。

#### 【0090】

好ましくは、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>10</sub>は、独立してC<sub>8</sub>～C<sub>18</sub>の、より好ましくはC<sub>12</sub>～C<sub>16</sub>のアルケニル基またはアルコキシ基、より好ましくはアルキル基またはアリールアルキル基であり、ここで、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>およびR<sub>9</sub>置換基の1つがベンジル基であることが好ましい。

#### 【0091】

あるいは、カチオン性化合物は、ポリアルコキシ基であるR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>またはR<sub>3</sub>の少なくとも一種またはR<sub>9</sub>を含むことが好ましい。

#### 【0092】

したがって、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびR<sub>9</sub>は、好ましくは独立して、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>の、好ましくはC<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>のアルコキシユニットを含み、2ないし50、好ましくは5ないし18のアルコキシリ化数を有するポリアルコキシ基である。R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、およびR<sub>10</sub>は、独立して、好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>の、より好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>のアル

ケニル基またはアルコキシ基、より好ましくはアルキル基、最も好ましくはメチル基またはエチル基である。

#### 【0093】

A、R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、独立して、好ましくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>のアルケニレン基またはより好ましくはアルキレン基、最も好ましくはメチレンまたはエチレンである。

#### 【0094】

好ましい化合物は、ベンズアルコニウムクロライドまたはマーカット (Merquat) 2200 (商品名、N, N-ジメチル-N-2-プロペニル-1-アノミニウムクロライドの2-プロペンアミドポリマーである) とすることができる。

#### 【0095】

上述した式の好ましいカチオン性化合物は、1つ以上の置換されたR<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>9</sub>またはR<sub>10</sub>基および/または置換されたR<sub>5</sub>および/または置換されたR<sub>6</sub>基を含み、ここで置換基は、シリコン、グルコース、フラクトース、およびサッカロースの誘導体からなる群から選択される。好ましいのは、グルコカット (Glucoquat) 125 (商品名、ラウリルジメチルグルセッター10-ヒドロキシジモニウムクロライド) とすることができる。

#### 【0096】

上述の式 (VI) の好ましいカチオン性化合物は、ベタイン、または好ましくはR<sub>1</sub>およびR<sub>9</sub>がメチル基であるスルホベタインである。

#### 【0097】

付加的なカチオン性化合物または付加的なトリエステル化合物は、本発明の組成物中に、組成物の重量の好ましくは0.01%ないし20%、より好ましくは0.05%ないし10%、最も好ましくは0.1%ないし5%のレベルで存在する。

#### 【0098】

プロセス

外皮上に存在する脂質分解性エステラーゼ酵素の酵素活性を低減するためのプロセスもまた、本発明に含まれ、そのプロセスは、好ましくは局所的に、本発明

の組成物を外皮に適用する工程、あるいは、好ましくは局所的に、本発明の組成物を外皮に適用する工程を含む。

#### 【0099】

それによって、酸が形成され（その場で）、好ましくは初期pHを7.9未満、より好ましくは7.5未満、さらには7.3に低下させることができる。

#### 【0100】

付加的な酸性源が存在することが好ましく、7.3未満、好ましくは6未満、さらには5に低下できるものである。

#### 【0101】

プロセスに用いられる組成物またはプロセスは、冒された領域への組成物の適用後、好ましくは15分以内で、リパーゼ酵素活性が、この領域における初期リパーゼ活性の35%まで、好ましくは25%まで、より好ましくは20%未満まで低下されるようなものである。

#### 【0102】

好ましくはプロセスに用いられる組成物またはプロセスは、冒された領域への組成物の適用の60分後、リパーゼ酵素活性は、この領域における初期リパーゼ活性の45%以下、好ましくは35%以下、より好ましくは30%以下になるようなものである。

#### 【0103】

このプロセスは、適切なレベルで存在する組成物を含む吸収性製品を皮膚に適用することによって、好ましく行なうことができる。

## 【国際調査報告】

| INTERNATIONAL SEARCH REPORT  |   | International Application No<br>PCT/US 98/24693                                |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
|--|---|--|------------|--|-----------------------|---|---|--------------------|---|---|-------------------------|---|-----|--|
| <b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b><br>IPC 6 A61K31/215 A61K31/14 A61K31/205 A61L15/20 A61F13/15<br>A61K7/48 A61K31/22 A61K31/225<br>// (A61K31/215, A61K31/14), (A61K31/215, A61K31/205), (A61K31/22,<br>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC   |   |  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| <b>B. FIELDS SEARCHED</b><br>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)<br>IPC 6 A61K   |   |  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched  |   |  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)   |   |  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| <b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b> <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Category *</th> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th style="text-align: left; padding: 2px;">Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td style="padding: 2px;">X</td> <td style="padding: 2px;">DATABASE WPI<br/>Section Ch, Week 9602<br/>Derwent Publications Ltd., London, GB;<br/>Class B01, AN 96-017139<br/>XP002059416<br/>&amp; JP 07 291868 A (TEIJIN LTD)<br/>see abstract<br/>---</td> <td style="padding: 2px;">1-3,6,<br/>13-15,18</td> </tr> <tr> <td style="padding: 2px;">X</td> <td style="padding: 2px;">US 4 556 560 A (BUCKINGHAM KENT W)<br/>3 December 1985<br/>see column 4, line 64 - column 5, line 21<br/>see column 5, line 35 - column 7, line 11<br/>see column 9, line 7-34<br/>see column 10, line 58 - column 13, line<br/>16<br/>see column 14, line 45 - column 15, line<br/>35<br/>---</td> <td style="padding: 2px;">1-3,6,<br/>13-18<br/>1-20</td> </tr> <tr> <td style="padding: 2px;">Y</td> <td style="padding: 2px;">-/-</td> <td style="padding: 2px;"></td> </tr> </tbody> </table> |   |  | Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. | X | DATABASE WPI<br>Section Ch, Week 9602<br>Derwent Publications Ltd., London, GB;<br>Class B01, AN 96-017139<br>XP002059416<br>& JP 07 291868 A (TEIJIN LTD)<br>see abstract<br>--- | 1-3,6,<br>13-15,18 | X | US 4 556 560 A (BUCKINGHAM KENT W)<br>3 December 1985<br>see column 4, line 64 - column 5, line 21<br>see column 5, line 35 - column 7, line 11<br>see column 9, line 7-34<br>see column 10, line 58 - column 13, line<br>16<br>see column 14, line 45 - column 15, line<br>35<br>--- | 1-3,6,<br>13-18<br>1-20 | Y | -/- |  |
| Category *   | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No.  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| X  | DATABASE WPI<br>Section Ch, Week 9602<br>Derwent Publications Ltd., London, GB;<br>Class B01, AN 96-017139<br>XP002059416<br>& JP 07 291868 A (TEIJIN LTD)<br>see abstract<br>---   | 1-3,6,<br>13-15,18   |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| X  | US 4 556 560 A (BUCKINGHAM KENT W)<br>3 December 1985<br>see column 4, line 64 - column 5, line 21<br>see column 5, line 35 - column 7, line 11<br>see column 9, line 7-34<br>see column 10, line 58 - column 13, line<br>16<br>see column 14, line 45 - column 15, line<br>35<br>--- | 1-3,6,<br>13-18<br>1-20  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| Y  | -/-   |  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of box C.   |   | <input checked="" type="checkbox"/> Patent/family members are listed in annex. |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| * Special categories of cited documents:<br>*A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance<br>*E* earlier document but published on or after the international filing date<br>*L* document which may throw doubt on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)<br>*O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means<br>*P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed<br>*T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention<br>*X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone<br>*V* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art<br>*G* document member of the same patent family                       |   |  |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| Date of the actual completion of the international search<br><b>26 February 1999</b>   |   | Date of mailing of the international search report<br><b>19.04.99</b>          |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |
| Name and mailing address of the ISA<br>European Patent Office, P.O. 5818 Patentlaan 2<br>NL - 2280 HV Rijswijk<br>Tel. (+31-70) 340-2040, Telex 31651 epo nl<br>Fax (+31-70) 340-3016  |   | Authorized officer<br><b>Engl, B</b>   |            |  |                       |   |   |                    |   |   |                         |   |     |  |

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

| INTERNATIONAL SEARCH REPORT   |  | International Application No<br>PCT/US 98/24693                                |
|---|--|--|
| <b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b><br>IPC 6 A61K31:14), (A61K31/225, A61K31:14)   |  |  |
| According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC   |  |  |
| <b>B. FIELDS SEARCHED</b><br>Minimum documentation searched (classification systems followed by classification symbols)   |  |  |
| Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched   |  |  |
| Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)  |  |  |
| <b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>   |  |  |
| Category *  | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No.  |
| X   | EP 0 414 605 A (ROUSSEL UCLAF)<br>27 February 1991<br>see page 2, line 43 - page 3, line 3<br>see page 3, line 47-54; claims 3,9<br>---  | 1-3,6,<br>13-18  |
| X   | US 4 454 159 A (MUSHER ALBERT)<br>12 June 1984<br>see column 1, line 27-51<br>see column 2, line 15-31; examples 1,2<br>---              | 1-3,6,<br>13-18  |
| X   | WO 96 16681 A (PROCTER & GAMBLE)<br>6 June 1996<br>see page 4, line 11 - page 5, line 6<br>see page 22, line 18 - page 23, line 2<br>--- | 1,3,6,<br>13-18  |
| E   | EP 0 815 841 A (COOOPERATIE COSUN U A)<br>7 January 1998<br>see page 2, line 47-50; claims 7,9<br>---                                    | 1,3,6,<br>13-18  |
| -/-   |  | -/-  |
| <input checked="" type="checkbox"/>   | Further documents are listed in the continuation of box C.   | <input checked="" type="checkbox"/> Patent family members are listed in annex. |
| <p>* Special categories of cited documents :</p> <p>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>"E" earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>"L" document which may show doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> <p>"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</p> <p>"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.</p> <p>"Z" document member of the same patent family</p> |  |  |
| Date of the actual completion of the international search<br><br>26 February 1999   | Date of mailing of the international search report<br><br>19.04.99   |  |
| Name and mailing address of the ISA<br>European Patent Office, P.O. 5018 Patenttaan 2<br>NL-2280 HV Rijswijk<br>Tel. (+31-70) 340-3040, Tx. 31 651 esp@nl<br>Fax (+31-70) 340-3016  | Authorized officer<br><br>Eng, B   |  |

Form PCT/ISA/210 (revised sheet) (July 1992)

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/US 98/24693

| C(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT |   |                       |
|---|---|-----------------------|
| Category *  | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
| Y   | GB 1 520 997 A (CASSENNE LAB SA)<br>9 August 1978<br>see column 1, line 28-39<br>---  | 1-20                  |
| Y   | EP 0 039 857 A (HENKEL KGAA)<br>18 November 1981<br>see page 1, line 4 - page 3, line 24<br>---   | 1-20                  |
| Y   | EP 0 750 903 A (COOPERATIE COSUN U A)<br>2 January 1997<br>see page 2, line 9-58<br>---   | 1-20                  |
| A   | PATENT ABSTRACTS OF JAPAN<br>vol. 016, no. 140 (C-0926), 8 April 1992<br>& JP 04 002345 A (DAIO PAPER CORP),<br>7 January 1992<br>see abstract<br>--- | 7-12                  |
| X   | US 4 034 677 A (HILL JOHN ANTHONY ET AL)<br>5 July 1977<br>see column 1, line 38-47; claim 6; example<br>1<br>-----                                   | 1-3, 6-8,<br>10       |

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/US 98/ 24693

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 1 of first sheet)**

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2.  Claims Nos.: because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
  
3.  Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See additional sheet

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
  
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
  
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
  
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

1 - 3, 5 - 20 (all in part)

Remark on Protest

The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International Application No. PCT/US 98/24693

**FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210**

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. Claims: 1-3, 5-20 (all in part)

The use of an ester of an alcohol or a polyol with a (mono)carboxylic acid for preparing a composition for prevention or treatment of lipolytic dermatitis.

2. Claims: 1-3, 5-20 (in part), 4 (in full)

The use of a polycarboxylic acid ester for preparing a composition for prevention or treatment of lipolytic dermatitis.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.  
PCT/US 98/24693

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) |  | Publication date |
|--|------------------|-------------------------|--|------------------|
| US 4556560 A                           | 03-12-1985       | CA 1225026 A            |  | 04-08-1987       |
|  |                  | EP 0117613 A            |  | 05-09-1984       |
|  |                  | JP 2533471 B            |  | 11-09-1996       |
|  |                  | JP 59186919 A           |  | 23-10-1984       |
| EP 0414685 A                           | 27-02-1991       | FR 2651125 A            |  | 01-03-1991       |
|  |                  | CA 2023810 A            |  | 24-02-1991       |
|  |                  | DE 69001730 T           |  | 04-11-1993       |
|  |                  | JP 3169822 A            |  | 23-07-1991       |
|  |                  | US 5091193 A            |  | 25-02-1992       |
| US 4454159 A                           | 12-06-1984       | NONE                    |  |                  |
| WO 9616681 A                           | 06-06-1996       | US 5635191 A            |  | 03-06-1997       |
|  |                  | AU 4135396 A            |  | 19-06-1996       |
|  |                  | BR 9509775 A            |  | 04-11-1995       |
|  |                  | CZ 9701612 A            |  | 12-11-1997       |
|  |                  | EP 0794803 A            |  | 17-09-1997       |
|  |                  | FI 972236 A             |  | 27-05-1997       |
|  |                  | HU 77660 A              |  | 28-07-1998       |
|  |                  | JP 10509895 T           |  | 29-09-1998       |
|  |                  | NO 972395 A             |  | 28-07-1997       |
|  |                  | ZA 9510060 A            |  | 02-07-1996       |
| EP 0815841 A                           | 07-01-1998       | NL 1003524 C            |  | 12-01-1998       |
| GB 1520997 A                           | 09-08-1978       | FR 2305172 A            |  | 22-10-1976       |
|  |                  | AT 343286 B             |  | 26-05-1978       |
|  |                  | AT 209076 A             |  | 15-09-1977       |
|  |                  | AU 500672 B             |  | 31-05-1979       |
|  |                  | AU 1237276 A            |  | 29-09-1977       |
|  |                  | BE 839999 A             |  | 27-09-1976       |
|  |                  | BR 7601829 A            |  | 28-09-1976       |
|  |                  | CA 1079642 A            |  | 17-06-1980       |
|  |                  | CH 598824 A             |  | 12-05-1978       |
|  |                  | DE 2612038 A            |  | 07-10-1976       |
|  |                  | DK 134276 A,B,          |  | 27-09-1976       |
|  |                  | GR 59321 A              |  | 13-12-1977       |
|  |                  | IE 43459 B              |  | 11-03-1981       |
|  |                  | JP 1289952 C            |  | 14-11-1985       |
|  |                  | JP 51136840 A           |  | 26-11-1976       |
|  |                  | JP 60014002 B           |  | 11-04-1985       |
|  |                  | LU 74639 A              |  | 28-01-1977       |
|  |                  | NL 7603236 A,B,         |  | 28-09-1976       |
|  |                  | OA 5288 A               |  | 28-02-1981       |
|  |                  | PH 11834 A              |  | 21-07-1978       |
|  |                  | PT 64947 A,B            |  | 01-04-1976       |
|  |                  | SE 423674 B             |  | 24-05-1982       |
|  |                  | SE 7602709 A            |  | 27-09-1976       |
|  |                  | US 4107333 A            |  | 15-08-1978       |
|  |                  | ZA 7601613 A            |  | 29-06-1977       |
| EP 0039857 A                           | 18-11-1981       | DE 3018114 A            |  | 19-11-1981       |
| EP 0750903 A                           | 02-01-1997       | NL 1000681 C            |  | 31-12-1996       |
| US 4034077 A                           | 05-07-1977       | NONE                    |  |                  |

フロントページの続き

| (51) Int. Cl. <sup>7</sup> | 識別記号   | F I            | テーマコード' (参考) |
|----------------------------|--------|----------------|--------------|
| A 61 K                     | 7/48   | A 61 K 31/20   |              |
|                            | 31/14  |                | 31/205       |
|                            | 31/20  |                | 31/225       |
|                            | 31/205 |                | 31/23        |
|                            | 31/225 | A 61 P 17/00   |              |
|                            | 31/23  | A 61 F 5/44    | H            |
| A 61 P                     | 17/00  | (A 61 K 31/225 |              |
| // A 61 F                  | 13/511 |                | 31:14)       |
|                            | 13/49  | (A 61 K 31/23  |              |
|                            | 5/44   |                |              |
| (A 61 K                    | 31/225 | A 61 F 13/18   | B            |
|                            | 31:14) | A 41 B 13/02   | E            |
| (A 61 K                    | 31/23  |                |              |

(81) 指定国 EP (AT, BE, CH, CY,  
DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,  
LU, MC, NL, PT, SE), OA (BF, BJ,  
CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG), AP (GH, GM, K  
E, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), EA (AM  
, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)  
, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG,  
BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, D  
K, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR  
, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP,  
KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV,  
MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ  
, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,  
SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US,  
UZ, VN, YU, ZW

(71) 出願人 ONE PROCTER & GANBL  
E PLAZA, CINCINNATI,  
OHIO, UNITED STATES  
OF AMERICA

(72) 発明者 グアラチーノ、マリオ  
イタリア国、アイ - 64028 シルビ・  
マリーナ、ビア・ダ・デノミナーレ 28,

F ターム(参考) 3B029 BB05 BF04  
4C003 HA02  
4C083 AC391 AC421 AC691 AC692  
AC711 CC04 CC05 CC06  
DD08 DD17 DD22 DD30 DD31  
DD41 EE13  
4C098 AA09 CC07 DD10 DD20 DD25  
DD26 DD30  
4C206 AA01 DA03 DA35 DB06 DB28  
DB47 FA41 FA58 MA01 MA04  
MA48 MA83 ZA89 ZB22